

⑩ 日本国特許庁 (JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭57-176987

⑬ Int. Cl.³
C 07 D 471/06
// A 61 K 31/47
31/495
31/535

識別記号
ADZ

庁内整理番号
6736-4C
6675-4C

⑭ 公開 昭和57年(1982)10月30日

発明の数 1
審査請求 未請求

(全 11 頁)

⑮ ビロロ [3,2,1-ij] キノリン-5-カルボン
酸誘導体

⑯ 特 願 昭56-63170

⑰ 出 願 昭56(1981)4月24日

⑱ 発 明 者 石川 廣
徳島県板野郡北島町新喜来字二
分1番地100

⑲ 発 明 者 宇野 哲之
徳島市川内町加賀須野463番地

の10

⑳ 発 明 者 狩野正信
徳島市川内町加賀須野463番地
の10

㉑ 発 明 者 中川量之
徳島市川内町大松774番地の1

㉒ 出 願 人 大塚製薬株式会社
東京都千代田区神田司町2丁目
19番地

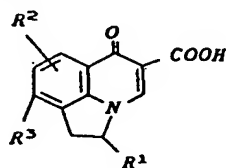
㉓ 代 理 人 弁理士 三枝英二 外2名

明 細 書

発明の名称 ビロロ [3,2,1-ij] キノリン-5
-カルボン酸誘導体

特許請求の範囲

(1) 一般式



(式中 R^1 は水素原子又は低級アルキル基を、
 R^2 は水素原子又はハロゲン原子を、 R^3 は 1-
-ビロリジニル基、モルホリノ基、チオモル
ホリノ基、1,2,5,6-テトラヒドロ-1-ビ
リジニル基、1-ビペリジニル基、又は置換基
としてオキソ基もしくはハロゲン置換低級ア

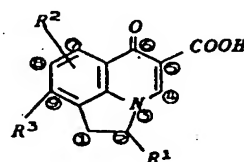
ルキル基を有する 1-ビペラジニル基を示す。)

で表わされる ビロロ [3,2,1-ij] キノリン-
5-カルボン酸誘導体及びその塩。

発明の詳細な説明

本発明は新規な ビロロ [3,2,1-ij] キノリン-
5-カルボン酸誘導体に関する。

本発明の ビロロ [3,2,1-ij] キノリン-5-
カルボン酸誘導体は、文献未載の新規化合物であ
つて下記一般式 (1) で表わされる。



(1)

(式中 R^1 は水素原子又は低級アルキル基を、
 R^2 は水素原子又はハロゲン原子を、 R^3 は 1-

F432 F433 F553 F653 F740 G010 G019 G100 H100 H101 H102 H103 H121
H122 H141 H2 H201 H211 H401 H402 H421 H422 H481 H521 H522 H601 H602
H603 H604 H608 H609 H641 H681 H682 H683 H684 H685 H686 H689 J0 J011
J012 J013 J1 J111 J221 J222 J311 J312 J321 J322 J5 J521 J522 J523
L941 M123 M129 M132 M135 M139 M210 M211 M212 M213 M214 M215 M216
M231 M232 M233 M240 M262 M272 M273 M280 M281 M282 M283 M311 M312
M313 M314 M315 M321 M322 M331 M332 M333 M334 M340 M342 M343 M344
M353 M373 M391 M412 M511 M521 M530 M531 M532 M540 M630 M640 M650
M710 M903 P220

ing Index Numbers: 00245; 02907; 03493

erwent Registry Numbers: 0247-S; 0918-S; 0919-S; 1053-S

PN=JP 57176987

of	Items	Index-term
1	1	PN=JP 57176985
2	1	PN=JP 57176986
3	1	*PN=JP 57176987
4	1	PN=JP 57176988
5	1	PN=JP 57176989
5	1	PN=JP 57176990
7	1	PN=JP 57176991
8	1	PN=JP 57176992
9	1	PN=JP 57176993
10	1	PN=JP 57176994
11	1	PN=JP 57176995
12	1	PN=JP 57176996

Enter P or PAGE for more

S SE3

S2 1 PN="JP 57176987" ✓

T 2/5/1

2/5/1

IALOG(R)File 351:Derwent WPI

c) 2000 Derwent Info Ltd. All rts. reserv.

03474136

IPI Acc No: 1982-22102E/198212

6,7-Dihydro 1-oxo 1H,5H-benzo(I,J)-quinolizine-2-carboxylic acids - and
1,2-dihydro 6-oxo-pyrrolo(3,2,1-I,J) quinoline-5-carboxylic acid derivs.
are antibacterials

Patent Assignee: OTSUKA PHARM CO LTD (SAKA)

Inventor: ISHIKAWA H; KANO M; NAKAGAWA K; UNO T

Number of Countries: 020 Number of Patents: 032

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week	
BE 891046	A	19820301				198212	B
GB 2086905	A	19820519	GB 8133890	A	19811110	198220	
DE 3144455	A	19820624	DE 3153221	A	19811109	198226	
FR 2493849	A	19820514				198226	
JP 57081486	A	19820521	JP 80158652	A	19801110	198226	
NL 8105075	A	19820601				198226	
NO 8103726	A	19820607				198226	
DK 8104952	A	19820621				198228	
FI 8103526	A	19820630				198229	
PT 73957	A	19820721				198232	
SE 8106642	A	19820913				198239	
ZA 8107733	A	19820903				198247	
JP 57176987	A	19821030				198249	
US 4399134	A	19830816	US 83497914	A	19830525	198335	

8401035	A	19840216			198418
2086905	B	19841205			198449
1179341	A	19841211			198503
3153221	A	19850124			198505
648845	A	19850415			198521
4552879	A	19851112			198548
448542	B	19870302			198711
1277896	A	19861215	SU 3527501	A	19821227 198733
1366055	A	19880107	SU 3354800	A	19811109 198837
8801625	B	19880902			198901
89007996	B	19890210			198910
1171646	B	19870610			199005
90022074	B	19900517	JP 8163170	A	19810424 199024
3144455	C	19901004			199040
8902887	A	19910315			199115
3153221	C	19910704			199127
8104748	A	19920215			199210
193457	B	19990701	NL 815075	A	19811110 199931

Priority Applications (No Type Date): JP 8163170 A 19810424; JP 80158652 A 19801110; JP 80158625 A 19801110

Patent Details:

Patent No	Kind	Lan	Pg	Main IPC	Filing Notes
E 891046	A		85		
L 193457	B			C07D-471/04	

Abstract (Basic): BE 891046 A

Pyrrolo (3,2,1-ij)-quinoline-5-carboxylic acid derivs. and tetra-hydro benzo (ij) quinolizine-2 -carboxylic acid derivs. of formula (I) and their salts are new. R1 is H or lower alkyl; R2 is H or halo; R3 is pyrrolidino (opt. substd. by hydroxymethyl), 1,2,5,6-tetrahydro-1-pyridyl, piperazino substd. by oxo or halo lower alkyl or a (R4)m-subst. morpholino, thiamorpholino or piperidino gp. of formula (A); R4 is H, lower alkyl, lower alkoxy, hydroxy, phenyl lower alkyl, lower alkanoyloxy, amino opt. substd. by lower alkyl or lower alkanoyl, oxo or carbamoyl; Z is O, S or -CH2-; m is 1 or 2 and n is 1 or 2. With the condition that when n is 2, then R3 is not halo-alkyl substd.-piperazino.

(I) are antibacterials effective against gram positive and gram-negative strains resistant to classical antibiotics, such as penicillins, cephalosporins, streptomycin, etc., and which have low toxicity to mammals and fish. MIC tests are described. (I) may be administered orally, rectally or parenterally or used as sterilising agents or antiseptics. Usual doses are 0.2-100 mg/kg taken 3-4 times daily.

Title Terms: DI; HYDRO; OXO; BENZO; QUINOLIZINE; CARBOXYLIC; ACID; DI; HYDRO; OXO; PYRROLO; QUINOLINE; CARBOXYLIC; ACID; DERIVATIVE; ANTIBACTERIAL

Derwent Class: B02

International Patent Class (Main): C07D-471/04

International Patent Class (Additional): A61K-031/395; A61K-031/43; A61K-031/47; C07D-209/00; C07D-215/22; C07D-221/00; C07D-455/00;

C07D-471/06; C07D-487/04; C07D-487/06

File Segment: CPI

?E PN=JP 02188570

Ref	Items	Index-term
E1	1	PN=JP 02188568
E2	1	PN=JP 02188569
E3	1	*PN=JP 02188570
E4	1	PN=JP 02188571